(19)日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11)特許出願公開番号 特開2001-89362 (P2001-89362A)

(43)公開日 平成13年4月3日(2001.4.3)

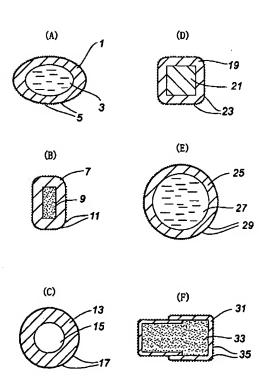
| (51) Int.Cl.7 | | 識別記号 | F I デーマコート*(参考) |
|---------------|------|-----------------------|---|
| A 6 1 K | 9/48 | | A 6 1 K 9/48 4 B 0 3 5 |
| A 2 3 L | 1/00 | | A 2 3 L 1/00 C 4 B 0 4 8 |
| A 2 3 P | 1/04 | | A 2 3 P 1/04 4 C 0 7 6 |
| A 6 1 J | 3/07 | • | A 6 1 J 3/07 Z |
| A 6 1 K | 9/16 | 1 2 2 | A 6 1 K 9/16 |
| | | 審査請求 | 未請求 請求項の数3 OL (全 6 頁) 最終頁に続く |
| (21)出願番号 | + | 特顧平11-271555 | (71) 出願人 396020279 |
| | | | 三生医薬株式会社 |
| (22)出顧日 | | 平成11年9月27日(1999.9.27) | 静岡県清水市入江3丁目10番21号 |
| | | | (72)発明者 近藤 隆 |
| | | | 静岡県清水市入江3丁目10番21号 三生医 |
| | | | 薬株式会社内 |
| | | | (74)代理人 100098936 |
| | | • | 弁理士 吉川 晃司 (外1名) |
| | | | Fターム(参考) 4B035 LE07 LG12 LG15 LK14 LP24 |
| | | | LP26 LP36 |
| | | | 4B048 PE02 PE12 PN30 |
| | | | 40076 AA56 BB01 CC23 DD38 EE42 |
| | | | FF36 FF52 CC01 |
| | | | |
| | | | 1 |

(54) 【発明の名称】 被包粒状物質及びその製造方法

(57)【要約】

【課題】医薬品、機能性食品、健康食品のカプセル剤などは、嚥下したり食した場合に噛み砕いて物理的に破壊したり、または溶かしたりすることなく瞬時に味を感じたりできるものがなかった。また、これらは、経時的に相互付着を起こし易かった。

【解決手段】包囲体の外表面の少なくとも一部に結晶性の析出物が露出した被包粒状物質。これらは、包囲体が容器形態でも皮膜形態でもよい。結晶性の水溶性物質、例えば、キシリトールが溶解した包囲体形成材(例えばソフトカプセル形成材)の溶液を所定の形態に、好ましくは低温低湿雰囲気で、固化し且つ乾燥させることにより、前記包囲体の外表面の少なくとも一部に前記結晶性の水溶性物質由来の析出物を露出させる。



【特許請求の範囲】

【請求項1】内容物が包囲体により被包されてなる被包 粒状物質であって、包囲体の外表面の少なくとも一部に 結晶性の析出物が露出していることを特徴とする被包粒 状物質。

【請求項2】請求項1に記載の被包粒状物質において、 包囲体が容器形態又は皮膜形態であることを特徴とする 被包粒状物質。

【請求項3】内容物が包囲体により被包されてなる被包 粒状物質の製造方法であって、結晶性の水溶性物質が溶 10 解した包囲体形成材の溶液を所定の形態に固化し且つ乾 燥させることにより、前記包囲体の外表面の少なくとも 一部に前記結晶性の水溶性物質由来の析出物を露出させ たことを特徴とする被包粒状物質の製造方法。

【発明の詳細な説明】

[0001]

【発明の属する技術分野】本発明は、医薬品、医薬部外 品、化粧品、機能性食品、健康食品、一般食品などの分 野で製造されている被包粒状物質及びその製造方法に関 するものである。

[0002]

【従来の技術】従来、医薬品、医薬部外品、化粧品、機 能性食品、健康食品、一般食品などの分野で製造されて いる粒状物質としては、カプセル剤、錠剤、丸剤、顆粒 剤、坐剤、トローチ剤、カプセル詰め入浴剤、カプセル 詰め化粧品、錠菓、糖衣菓子、キャンデー、キャラメ ル、ガムなどの菓子、顆粒食品、打錠食品などがある。 上記の粒状物質は、酸化、褐変、吸湿、溶解、軟化等の 変質を防止したり、取り扱いを容易にするために、カプ セル等の容器に入れて、或いはそれらの表面を保護皮膜 30 で覆ったりして、即ち被包されて保存されているものも ある。

【0003】ところで、上記のカプセルや保護皮膜など 内容物を包囲する包囲体の材料は、通常ゼラチン等を基 剤としているが、かかる基剤は概して無味である。従っ て、経口用の医薬品、医薬部外品、健康食品、菓子など を被包する場合には、嚥下し易くしたり食し易くするた めに前記包囲体材に味や香りをつけることが提案されて いる。例えば、特開昭61-58537号公報には、包 スの呈味成分を加えて、ソフトカプセルを製造する方法 が開示されている。

【0004】しかしながら、上記の方法で製造したカプ セルは口に含んでも呈味成分の味及びそれに伴う香りや 清涼感を瞬時には感じることができないという欠点があ る。その理由は呈味成分の分子がゼラチン(基剤)分子 が構成するゼラチンゲル、即ちゼラチンネットワーク (網目構造)の中に取り込まれており、外表面には殆ど 露出されていないからである。

されるため、保存中に、温度、湿度、圧力などの外的影 響を受けて経時変質し、相互に付着してブロック化し易 い。この問題は、粒状物質が経口用であるか否かを問わ ない。

【0006】かかる変質を阻止するために、包囲体の周 囲または包囲体材の溶液に、カルシウム含有物質、ワッ クス等の鑞類、トランスグルタミナーゼ等の酵素類、マ ンニトール、シリコーン樹脂、プロピレングリコール、 乳化剤、コーンスターチ、セルロースとデンプンの混合 物などの添加剤を加えることが提案されている。しかし ながら、効果は期待したほどではなかった。また、実用 化するには、別の問題点もあった。

【0007】更に、需要者が購買意欲をそそられるよ う、粒状物質の外観が美観を呈するものであることが望 ましい。

[0008]

【発明が解決しようとする課題】本発明は上記した従来 の問題点に鑑みて為されたものであり、嚥下したり食し た場合に噛み砕いて物理的に破壊したり、または溶かし 20 たりすることなく瞬時に味を感じることができる被包粒 状物質及びその製造方法を提供することを目的とする。 また、本発明は、服用の如何に係わらず、経時的に相互 付着を起こし難い被包粒状物質及びその製造方法を提供 することを目的とする。更に、本発明は、美観を有する 被包粒状物質及びその製造方法を提供することを目的と する。

[0009]

【課題を解決するための手段】この目的を達成するため に、請求項1の発明は、内容物が包囲体により被包され てなる被包粒状物質であって、包囲体の外表面の少なく とも一部に結晶性の析出物が露出していることを特徴と する被包粒状物質である。

【0010】請求項2の発明は、請求項1に記載の被包 粒状物質において、包囲体が容器形態又は皮膜形態であ ることを特徴とする被包粒状物質である。

【0011】請求項3の発明は、内容物が包囲体により 被包されてなる被包粒状物質の製造方法であって、結晶 性の水溶性物質が溶解した包囲体形成材の溶液を所定の 形態に固化し且つ乾燥させることにより、前記包囲体の 囲体材の溶液に甘味料、コーヒーなどの嗜好性飲料エキ 40 外表面の少なくとも一部に前記結晶性の水溶性物質由来 の折出物を露出させたことを特徴とする被包粒状物質の 製造方法である。

[0012]

【発明の実施の形態】本発明の被包粒状物質の構成を被 包される内容物と、包囲体とに分けて、以下に説明す

(内容物)被包される内容物には、医薬品、医薬部外 品、化粧品、機能性食品、健康食品、一般食品などの分 野で製造されている、カプセル剤、錠剤、丸剤、顆粒 【0005】また、包囲体の外表面は通常大気中に暴露 50 剤、坐剤、トローチ剤、カプセル詰め入浴剤、カプセル 詰め化粧品、錠菓、糖衣菓子、キャンデー、キャラメル、ガムなどの菓子、顆粒食品、打錠食品などの物質がある。これらは、常温で液状でも、半固体状(ペースト状)でも、錠剤のような固形状でも、更には、粉末状、顆粒状でもよい。また、空気、酸素のようなガス状でもよい。更には、既に被包されている多層状のものでもよい。なお、半固形状、固形状、顆粒状などの場合には、市販の造粒機、顆粒機、糖衣掛機(例えば、レボルパン)などの成型機を用いて成型する。

【0013】(包囲体)

包囲体の成分

包囲体を形成する基剤としては、特に限定されるものではないが、ゼラチン、寒天、アルギン酸、カラギーナン、ペクチン、カードラン、ジェランガム、アミロペクチン、セルロース、キチン、デキストリン、可溶性デンプンなどの多糖類が用いられる。また、添加剤として、グリセリン、ソルビトール、マンニトール、セラック、シリコーン樹脂、油脂類等に代表される可塑剤、安定化剤、保存剤、着色剤、離型剤が適宜配合される。更には、着色料や香料も適宜配合される。

【0014】包囲体の外表面に露出した結晶性の析出物 この析出物は、結晶性の水溶性物質由来のものである。 析出物の種類としては、特に限定されるものではない が、ソルビトール、キシリトール、マンニトール、エリ トリトール、マルチトール、ラクチトール等の糖アルコ ール、アラビノース、キシロース、グルコース、フラク トース、ガラクトース、マンノース等の単糖類、マルト ース、トレハロース、ネオトレハロース、スクロース等 の二糖類、ラフィノース、シアリルラクトース、フコシ ルラクトース等の三糖類、マルトオリゴ糖、フラクトオ 30 リゴ糖、ガラクトオリゴ糖、バラチノース等のスクロオ リゴ糖、キシロオリゴ糖、フスマオリゴ糖、寒天オリゴ 糖、タマリンドオリゴ糖、キトサンオリゴ糖等のオリゴ 糖(寡糖類)、グルタミン酸、アスパラギン酸、グリシ ン、システイン、シスチン、メチオニン等のアミノ酸ま たはその塩、グルタチオン等のオリゴペプチド、更に は、甘味性物質、塩味性物質、アミノ酸または核酸等の 旨味性物質、カフェイン等の苦味性物質、タンニン等の 渋味性物質、酸味性物質がある。なお、二種類以上が含 まれていてもよい。

【0015】析出物は、包囲体の外表面の少なくとも一部に露出していればよい。即ち、包囲体の外表面が全て析出物で覆われている必要はなく、また、析出物の一部は包囲体中に完全に埋没した状態で存在してもよい。但し、析出物は、包囲体の外表面に微細な結晶として均質に且つ一様に露出しているのが好ましい。その場合には、包囲体は二層に分離しているようにみえる。

【0016】包囲体中の析出物を除いた余部分と析出物 包囲体に溶解している結晶性の水溶性物質は濃度の格差 の重量比の適切な範囲は、析出物の種類により異なる。 例えば、本発明者の実施した試験によれば、析出物がキ 50 き寄せられ、その水分子に溶解する。その結果、外表面

シリトールの場合には、キシリトール: 余部分=40~200:130が好ましく、キリシトール: 余部分=80~160:130がより好ましいことが判明している。これに対して、析出物がカフェインの場合には、カフェイン: 余部分=2~50:130が好ましく、カフェイン: 余部分=4~20:130がより好ましいことが判明している。

【0017】また、上記の重量比の適切な範囲は、包囲体の外表面への析出物の露出状況によっても変動する。 10 なお、包囲体自体に本質的に求められている内容物の保存性や内容物を放出するときに必要な崩壊性に悪影響を及ぼさない範囲であることはもとよりである。

【0018】包囲体の形態は、被包状態が粒状であればよく、例えば、ソフトカプセル、ハードカプセル、シームレスカプセル、マイクロカプセルなどのような容器形態でも、内容物、例えば錠剤や顆粒物の表面に一体的に施される皮膜形態でもよい。

【0019】以下に、本発明に係る被包粒状物質の製造方法を説明する。溶液状の包囲体形成材を使用する。なお、この中に結晶性の水溶性物質が溶解していることは勿論である。通常は、温湯溶液を使用する。包囲体の形態がソフトカプセルやシームレスカプセルの場合には、市販のソフトカプセル充填機やシームレスカプセル充填機を用いて、内容物の封入と同時に成型を行う。包囲体の形態がハードカプセルの場合には、容器形態の包囲体を成型した後に、内容物を入れる。また、包囲体の形態が皮膜の場合には、浸漬及び引上げ、滴下、吹付けなどにより固形の内容物の表面を被覆する。

【0020】カプセル成型や被覆等が施された後、溶液状の包囲体形成材を固化させ且つ乾燥させる。固化はゲル化することにより進行させる。この場合、ゲル化は、主に強制冷却により起こさせるが、カルシウム、カリウム、マグネシウムなどの塩類との反応、酵素との反応などを利用することにより行ってもよい。溶液状の包囲体形成材の冷却に伴う溶解度の低下により、結晶性の水溶性物質が溶液中から固化しつつある包囲体の外表面側に移動してくる。

【0021】その後固化された包囲体を乾燥させる。乾燥は、送風による場合には固化工程と重複して行えるが、加熱による乾燥の場合には固化工程の終了後に行う。この乾燥工程により、結晶性の水溶性物質が最終的に折出する。外表面にあったものは、折出物が露出することになる。

【0022】なお、この乾燥工程で、周囲を一旦高湿(加湿)雰囲気にするのが好ましい。包囲体の外表面に接する空気中の湿度が高いと外表面に水分子が吸着するが、その水分子は容易に皮膜中に侵入できない。一方、包囲体に溶解している結晶性の水溶性物質は濃度の格差を解消しようとして、外表面に吸着している水分子に引き客せられ、その水分子に溶解する。その特里、外表面

5

に結晶性の水溶性物質の水溶液層がより積極的に形成される。これを乾燥すれば、析出物が外表面に多く露出することになる。場合によっては、上記の高湿雰囲気下による処理と乾燥処理とを繰り返す。すると、析出物が外表面上を均一に且つ隙間無く覆うようになる。

【0023】以上、本発明の実施の形態について詳述してきたが、具体的な構成はこの実施の形態に限られるものではなく、本発明の要旨を逸脱しない範囲における設計の変更などがあっても本発明に含まれる。

[0024]

【実施例】以下に本発明の実施例を説明するが、本発明 の範囲は以下の実施例により限定されるものではない。 実施例1

内容物としてビタミンE含有油脂を用い、包囲体材溶液 として、ゼラチン(ニッピゼラチン工業会社製のアルカ リゼラチン(ブルーム165~185):100重量 部、グリセリン:30重量部、着色料:1重量部、キシ*

*リトール(結晶性の水溶性物質、東和化成会社製:キシリット):0(比較例)、20、40、80、120、160、200、240重量部、水:90重量部の溶液を用いた。前記溶液(70℃)を真空脱気、沪過した後、回転金型式ソフトカプセル充填機を用いて、内容物が被包されたソフトカプセル(OVAL、No.5)を成型し固化させた。その後直ちに、湿度30%で温度31℃の空気雰囲気中で、回転式送風乾燥機を用いて5時間乾燥し、次に、湿度80%で温度28℃の空気雰囲気中に3時間置いた後、更に、湿度30%で温度31℃の空気雰囲気中で、回転式送風乾燥機を用いて12時間乾燥して、最終的に皮膜水分を約10%とした。得られた8種類のサンプル(ソフトカプセル形態)について行った品質判定試験の結果を以下の表1に示す。

【0025】

【表1】

| キシリト ール添加 | 工程適性 | 析出物に よる表面 の白さ | 瞬時に感 じる甘さ | 相互付着 | 総合評価 |
|-----------|------|---------------------|--------------|------|---------|
| 0 | 0 | × | × | Δ | CONTROL |
| 2 0 | 0 | Δ | × | Δ | × |
| 4 0 | 0 | 0 | Δ | 0 | Δ |
| 80 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 · |
| 120 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 1.60 | 0 | 0 | . @ | 0 | 0 |
| 200 | Δ | 0 | 0 | 0 | Δ |
| 240 | × | 0 | 0 | 0 | × |

【0026】表1中、工程適性は製品の歩留まりで判定した。表面の白さは目視により判定し、甘さは舌に含んで判定した。相互付着は温度40℃、湿度75%で14日間保存した後に判定した。良い結果から、順に◎、○、△、×で示してある。キシリトールの重量比が80~160重量部のサンプルは、外表面に微細な白いキシリトールの結晶が均一に露出した美観を有するものであり、嚥下したり食した場合には瞬時にキシリトールの清涼感ある甘みを感じることができた。また、保存した場40

あるキシリトールが皮膜に柔軟性を与えたため、より嚥下したり食し易くなった。 【0027】なお、図1のAは実施例1で製造したサンプルの模式的断面を示す図であり、1はソフトカプセル

状包囲体、3はビタミンE含有油脂(内容物)、5はキ

シリトールの露出した析出物を、それぞれ示す。

合にも相互付着は殆ど見られなかった。なお、皮膜中に

【0028】実施例2

市販のクロレラ錠剤の表面を実施例1で用いた温湯溶液 して、実施例1で用いた処理雰囲気中、実施例1で用を用いて、実施例1で用いた処理雰囲気中で、均一にス※50 た処理工程に従ってソフトカプセル(ROUND、N

※プレーコートし皮膜を成型し固化・乾燥させた。得られた8種類のサンプル(皮膜形態)について行った品質判定試験の結果、工程適性、表面の白さ、甘さ、相互付着において良好な結果が得られたものは、皮膜が二層に分離したものであった。

【0029】なお、図1のBは実施例2で製造したサンプルの模式的断面を示す図であり、7は皮膜状包囲体、9はクロレラ錠剤(内容物)、11はキシリトールの露出した折出物を、それぞれ示す。

【0030】実施例3

内容物として空気を用い、包囲体材溶液として、ゼラチン(ニッピゼラチン工業会社製のアルカリゼラチン(ブルーム165~185):100重量部、グリセリン:30重量部、天然甘味料:5重量部、カラメルカラー:1重量部、天然カフェイン(結晶性の水溶性物質、小城製薬会社製:茶素):0(比較例)、5、10、50、100重量部、水:90重量部の混合溶液を用いた。そして、実施例1で用いた処理雰囲気中、実施例1で用いた処理ではつてソフトカプセル(ROUND、N

7

o. 3)を成型し固化し乾燥させた。得られた5種類の * [0031] サンプル (ソフトカプセル形態) について行った品質判 【表2】 定試験の結果を以下の表2に示す。

| カフェイ ン添加量 | 工程適性 | 折出物に よる表面 の白さ | 瞬時に感 じる甘さ | 相互付着 | 総合評価 |
|--------------|------|---------------------|--------------|------|---------|
| 0 | 0 | × | × | Δ | CONTROL |
| 5 | 0 | Δ_ | © | Δ | 0 |
| 1 0 | 0 | 0 | O _ | 0 | 0 |
| 5 0 | Δ | © | © | 0 | Δ |
| 100 | × | | | | |

【0032】表2中、工程適性、表面の白さ、苦さ、相 互付着は表1と同じ手法で判定した。なお、「…」は、 全量が溶解した溶液をつくることができず、途中で中止 したことを示す。カフェインの重量比が5~10重量部 のサンプルは、外表面に微細な白いカフェインの結晶が 露出した美観を有するものであり、嚥下したり食した場 20 合には瞬時にカフェインの苦味を感じることができた。 また、保存した場合にも相互付着は殆ど見られなかっ た。このサンプルは、いずれもチューインガムとは別の 噛みごたえを有しており、「食べられるガム様食品」と も言うべきものであった。

【0033】なお、図1のCは実施例3で製造したサン プルの模式的断面を示す図であり、13はソフトカプセ ル状包囲体、15は空気(内容物)、17はカフェイン の露出した析出物を、それぞれ示す。

【0034】実施例4

【0037】実施例5

内容物として固形のチョコレートを用い、包囲体材溶液 として、ゼラチン(ニッピゼラチン工業会社製のアルカ リゼラチン (ブルーム165~185):100重量 部、ペクチン (三晶会社扱、HM): 2重量部、エリト リトール (結晶性の水溶性物質、日研化学会社製):0 (比較例)、50、100、150、200重量部、 水:90重量部の混合溶液を用いた。そして、実施例1 で用いた処理雰囲気中、チョコレートを浸漬し、引き上 げて皮膜を成型し固化・乾燥させた。

ついて行った品質判定試験の結果、工程適性、表面の白 さ、甘さ、相互付着において良好な結果が得られたもの は、皮膜が二層に分離したものであった。この製品は、 夏季の高温下においても皮膜が溶解しなかったため中の チョコレートが放出されず、手にべとつかなかった。 【0036】なお、図1のDは実施例4で製造したサン プルの模式的断面を示す図であり、19は皮膜状包囲 体、21はチョコレート(内容物)、23はエリトリト ールの露出した析出物を、それぞれ示す。

※内容物として入浴剤を用い、包囲体材溶液として、ゼラ チン(ニッピゼラチン工業会社製のアルカリゼラチン (ブルーム165~185):100重量部、グリセリ ン:30重量部、マルトース(結晶性の水溶性物質、日 本食品化工会社製):50重量部、水:90重量部の溶 液を用いた。前記溶液を実施例1で用いた処理雰囲気 中、実施例1で用いた処理工程に従って、ソフトカプセ ル (ROUND、No. 160)を成型し固化・乾燥さ せた。

【0038】得られたサンプル(ソフトカプセル形態) について行った品質判定試験の結果、従来のものに比べ て保存中の相互付着、ブロック化が少なかったばかりで なく、入浴用の湯中では直ちに崩壊して内容物が放出さ nr.

【0039】なお、図1のEは実施例5で製造したサン 30 プルの模式的断面を示す図であり、25はソフトカプセ ル状包囲体、27は入浴剤(内容物)、29はマルトー スの露出した析出物を、それぞれ示す。

【0040】実施例6

内容物として苦味の強いアロエ粉末を用い、包囲体材溶 液として、ゼラチン(ニッピゼラチン工業会社製のアル カリゼラチン(ブルーム165~185): 100重量 部、乳化剤:1重量部、フラクトース(結晶性の水溶性 物質、加藤化学会社製):20重量部、水:150重量 部の溶液を用いた。前記溶液(70℃)を真空脱気、粘 【0035】得られた5種類のサンプル(皮膜形態)に 40 度調整した後、この溶液にステンレス製のピンを浸漬し て回転しながら引き上げて成型し、固化した。その後直 ちに、湿度30%で温度25℃の空気雰囲気中で、皮膜 の水分が約12%になるまで乾燥して、容器形態の包囲 体をつくった。そして、その中にアロエ粉末を入れた後 密封した。

> 【0041】得られたサンプル(ハードカプセル形態) について行った品質判定試験の結果、従来のものに比べ て保存中の相互付着、ブロック化が少なかったばかりで なく、嚥下し易かった。また、カプセルの層が二層に分 ※50 離したものであった。

9

【0042】なお、図1のFは実施例1で製造したサン プルの模式的断面を示す図であり、31はハードカプセ ル状包囲体、33はアロエ粉末(内容物)、35はフラ クトースの露出した折出物を、それぞれ示す。

[0043]

【発明の効果】本発明の被包粒状物質は、嚥下又は食し た場合に、外表面に露出した析出物の溶解により味、そ れに伴う香り、清涼感などを瞬時に感じることができ る。保存した場合には、析出物が粒状物質の相互付着、 ブロック化を阻止する。また、析出物を外表面に均一に 10 5、11、17、23、29、35

露出させれば、品の良い美観を呈する。加えて、包囲体 中に析出物の一部を残せば、柔軟性が出ると共に崩壊し 易くなる。

10

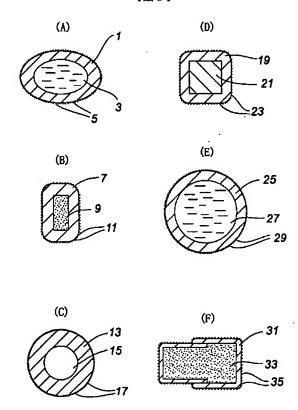
【図面の簡単な説明】

【図1】本発明の実施の形態に係る被包粒状物質の断面 を示す図である。

【符号の説明】

1, 7, 13, 19, 25, 31 包囲体 3, 9, 15, 21, 27, 33 内容物 析出物

【図1】



フロントページの続き

A 6 1 K 9/20

(51) Int. Cl.7

識別記号

FΙ

テーマコード(参考)

A 6 1 K 9/20

2/1/2008, EAST Version: 2.2.1.0

CC=JP DATE=20010403 KIND=Kokai PN=13089362

ENCASED PARTICLE SUBSTANCE AND ITS PRODUCTION METHOD [HI HO RYUJO BUSSHITSU OYOBI SONO SEIZO HOHO]

TAKASHI KONDO

UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE WASHINGTON, D.C. JANUARY 2008 TRANSLATED BY SCHREIBER TRANSLATIONS INC.

| PUBLICATION COUNTRY | (10): | JP |
|-------------------------------|--------|--|
| DOCUMENT NUMBER | (11): | 200189362 |
| DOCUMENT KIND | (12): | A |
| PUBLICATION DATE | (43): | 20010403 |
| APPLICATION NUMBER | (21): | 11271555 |
| APPLICATION DATE | (22): | 19990927 |
| INTERNATIONAL CLASSIFICATION | (51): | 1/00 ; A23P 1/04 ; |
| PRIORITY COUNTRY | (33): | |
| PRIORITY NUMBER | (31): | |
| PRIORITY DATE | (32): | |
| INVENTOR(S) | (72): | |
| APPLICANT(S) | (71): | SANSEI PHARMACY |
| DESIGNATED CONTRACTING STATES | (81): | |
| TITLE | (54): | ENCASED PARTICLE SUBSTANCE AND ITS PRODUCTION METHOD |
| FOREIGN TITLE | [54A]: | HI HO RYUJO BUSSHITSU OYOBI SONO SEIZO HOHO |

[Title of Invention] Encased particle substance and its production method

/2

[Scope of Patent Claims]

[Claim 1] It is an encased particle substance whose content is encased by a wrapper. The encased particle substance is characterized in that the crystalline precipitate is discharged to at least one part of the external surface of the wrapper.

[Claim 2] In the encased particle substance stated in Claim 1, the encased particle substance is characterized in that the wrapper is in a container form or film form.

[Claim 3] This is the production method of the encased particle substance whose content is encased by a wrapper. This production method of the encased particle substance is characterized in that the aforementioned crystalline precipitate that originates from the water soluble substance is discharged to at least one part of the external surface of the aforementioned wrapper.

¹ the numbers in the margin indicate pagination in foreign text

[Detailed explanation of the invention]
[0001]

[Technology field relating to the invention] The invention pertains to the encased particle substance and its production method used for different fields like for medicine product, external use medicine product, cosmetic product, performance food product, health food product and general food product.

[0002]

[Prior Art] The examples of the conventional particle substance produced in the fields like for medical supplies, external use medical supplies, cosmetic product, performance food product, health food produce and general food product are capsules, tablets, pills, granules, capsule stuffed bath agent, capsule stuffed cosmetic; candy like fruit tablet, sugar coated candy, candy, caramel, gum, food granule and punched tablet food product. The aforementioned particle substance is covered with a protective film on the surface to prevent properties change like oxidation, deterioration, moisture absorption, solubility and softening. Since it can be handled easily, it is introduced into a container like a capsule or these surfaces are covered by the protective film, that is, it is maintained in the wrapper.

[0003] However, the materials in the wrapper used for wrapping the contents are the aforementioned capsule and protective film, the basic agent is normal gelatin but this basic agent is tasteless. Therefore, when wrapping the medicine for oral administration, the medicine for external use, the health food product, the fruit, etc., the offer is to provide taste and flavoring to the aforementioned wrapper material so it can be eaten easily and swallow easily. For example, as disclosed in Patent Publication 61-58537, sweetener is added to the solution of the wrapper material and the tasty beverage extract taste imparting components are added such as coffee, the method for producing the soft capsule was disclosed.

[0004] However, the drawback is that the capsule produced with the aforementioned method cannot provide instantaneously the flavoring and cooling sensation that accompanied the taste of the taste imparting component contained in the mouth. The reasoning is that it was in a gelatin gel, the molecules in the taste imparting component were made up of the gelatin molecules (base agent). That is, they were enclosed inside the gelatin network (net structure). Almost none of them discharged to the exterior.

[0005] Also, since the external top surface of the wrapper was exposed to the normal atmosphere, during storage, the properties changed over time affected by the external environments like the temperature, the humidity and pressure, they turned into blocks easily, adhered to each other. The problem is the particles cannot be taken orally.

[0006] To prevent the properties change, the offer was to add additives like coating with wax, calcium containing substance, enzymes such as tranglutaminase, mannitol, silicon resin, propylene glycol, emulsion agent, cornstarch, and a mixture of cellulose and starch. However, almost no effect was observed. Also, there were other problems during practical application.

[0007] In addition, the desire to obtain a particle substance with good external appearance so it appeals to the consumers.

[8000]

[The problems resolved by the invention] The purpose of the invention is to focus on the conventional problems as described above and offer a encased particle substance and its production method so it can be swallowed easily, broken down physically by the teeth and the taste can be tasted instantaneously without dissolving. Also, the invention

offers an encased particle substance and its production method so it is difficult for the particles to adhere over time and is suitable for any application. In addition, the invention offers the encased particle substance having good appearance and its production method.

[0009]

[Means for resolving the problems] To achieve this purpose, the invention of Claim 1 is the encased particle substance whose content is encased by a wrapper. The encased particle substance is characterized in that the crystalline precipitate is discharged to at least one of the external surface of the wrapper.

[0010] The invention of Claim 2 is a encased particle substance of the encased particle substance stated in Claim 1, the encased particle substance is characterized in that the wrapper is in a container form or film form.

[0011] The invention of Claim 3 is the production method of the encased particle substance whose content is encased by a wrapper. This production method of the encased particle substance is characterized in that the aforementioned crystalline precipitate that originates from the water soluble substance is discharged to at least one of the external surfaces of the aforementioned wrapper.

[0012]

[State of implementing the invention] The constitution of the encased particle substance of the invention is divided into the contents to be encased and the wrapper, this is explained below.

(Contents) The substances in the encased contents are medical supplies, external use medical supplies, cosmetic product, performance food product, health food produce and general food product in capsules, tablets, pills, granules, agent, capsule stuffed bath agent, capsule stuffed cosmetic; fruit like fruit tablet, sugar coated fruit, candy, caramel, fruit granules food product and punched fruit product. It is preferred that they are in the liquid form at normal temperature and, in the semi-solid form (paste from) in the solid form like tablet. In addition, it is in the powder form or particle form. Also, it is in the gas form like air and oxygen. In addition, it is encased in multi-layers. Furthermore, when it is in the semi-solid form, solid form, particle form, it is molded using a molding machine such as a commercial particle machine, granulating machine and sugar coating machine (for example Revolpan).

[0013] (Wrapper)

Components in the wrapper

An example of the base agent forming the wrapper is not particularly limited but these can be used, gelatin, agaragar, alginic acid, caraginan, pectin, curdlan, jelan gum, amilopectin, cellulose, chitin, dextrin, polysaccharide like soluble starch. Also, the example of the additive is glycerin, sorbitol, mannitol, shellac, silicon resin, the molding agent typically represented in the oil, stabilizing agent, maintaining agent, coloring agent and mold separating agent, a suitable proportion is combined. In addition, suitable proportion of the coloring agent and fragrance are combined.

[0014] The crystalline precipitate exposed to the external surface of the wrapper

This precipitate originated from the crystalline water soluble substance. The example of the type of precipitate is not particularly limited but sugar alcohol like sorbitol, xylitol, mannitol, erythritol, maltitol and lactol; the monosaccharide like alabinose, xylose, glucose, lactose, galactose and manose; bi-saccharide like maltose, trehalose, neotrehalose, sucrose, etc; tri-saccharide like raffinose, ciaryl lactose, fucoshil lactose; sucro oligo saccharide such as malto oligo saccharide, fructo oligo

saccharide, galacto oligo saccharide and balatinose; oligo saccharide (minimum sugar type) such xylo oligo saccharide, fusma oligo saccharide, agar-agar oligo saccharide, tamarind oligo saccharide, chitosan oligo saccharide and; amino acid such as glutamic acid, asparadinic acid, glycine, cistein, cistin, methionin and its salt and oligo peptide like glutathione. In addition, the sweetening substance, the salty substance, amino acid or nucleic acid flavoring substance and bitter substance like caffeine, tart flavoring like tannin and acidic flavoring substance. Furthermore, it is preferred that more than 2 types are contained.

[0015] It is preferred that the precipitate is discharged out into at least one part of the external surfaces of the wrapper. That is, the whole external surface of the wrapper does not have to be covered by the precipitate. Also, it is preferred a part of it exists in the state that is completely buried in the wrapper. That is, it is preferred that the precipitate is discharged out uniformly and similarly as the fine crystals to the external surface of the wrapper.

[0016] The suitable range of the weight ratio of the precipitate and surplus part excluding the precipitate in the wrapper is different depending on the type of

precipitate. For example, according to the experiment implemented by the inventor, for the case of the precipitate xylitol, it is preferred that xylitol: surplus part = 40 - 200: 130. It is clear that it is most preferred when xylitol: surplus part = 80 - 160 : 130. In contrast to this, when the precipitate is caffeine, caffeine : surplus part = 2 - 50 : 130 is preferred but it is clear that it is most preferred when caffeine : surplus part 4 - 20: 130. [0017] Also, the suitable range of the aforementioned weight ratio fluctuates due to the discharge conditions of the precipitate discharging to the external surface of the wrapper. Furthermore, it is preferred to be in the range that does not affect the maintenance property and the break up property required for the contents to be released from the wrapper.

[0018] The state of the wrapper is preferred to be in the particle state. For example, it is in the container form like in a soft capsule, hard capsule, seamless capsule and microcapsule. It is preferred that the film state is implemented over the entire surface of the particle and tablet.

[0019] The production method of the encased particle substance pertaining to the invention is explained. The wrapper molding material is used in the liquid state.

Furthermore, the water soluble crystalline substance is dissolved in this. Normally, a hot solution is used. When the wrapper state is in the soft capsule and seamless capsule, a commercial soft capsule filling machine and a seamless capsule filling machine are used. The molding is performed at the same time with the filling of the contents. When the state of the wrapper is in the hard capsule, after the wrapper of the container state is molded, the contents are introduced. Also, when the state of the wrapper is a film, the surface of the contents in the solid form is covered by immersion and lifting up, dropping down and suction.

[0020] After the capsule molding and the cover are implemented, the wrapper molding material in the liquid form is solidified and dried. The solidification is advanced by gel forming. In this case, the gel formation is generated mainly by forced cooling and it is preferred that it is performed by using the reaction with enzyme and reaction with salt such as calcium, potassium and magnesium. By reducing the solubility that accompanies the cooling of the molding material of the wrapper in the liquid form, the water soluble crystalline substance moves to the external surface side of the wrapper which solidified from the solution.

[0021] Then, the solidified wrapper is dried. The drying is performed by repeating the solidification process by hot air. When the solidification ends after the drying by hot air, the water soluble crystalline substance is precipitated by this drying process, the precipitate is discharged out to the external surface.

[0022] Furthermore, in this drying process, it is preferred that the environment is in a high humidity (additional humidity), atmosphere. For increasing the humidity level in the air that contacts the external surface of the wrapper, moisture is absorbed into the external surface and the water molecule cannot immersed into the film easily. On the other hand, the water soluble crystalline substance dissolving in the wrapper is dissolved in that water molecules and pulled into the water molecules absorbing into the external surface. That result is that the water soluble layer in the water soluble crystalline substance at the external surface is laminated. When this is dried, a lot of the precipitate discharged out to the external surface. Thus, the drying process and the process by high humidity atmosphere are repeated. Then, the precipitate covers the top of the external surface uniformly without gaps.

[0023] The state of implementing the invention is discussed but the specific constitution is not limited to this implementation state. Modification of the design within the range of the gist of the invention can be included in the invention.

[0024]

[Implementation examples] The implementation example of the invention is explained below but the range of the invention is not limited by the implementation examples shown below.

Implementation example 1

The vitamin E containing oil is used as the contents. An example of the encasing solution is gelatin (alkali gelatin (Bloom 165-185) made by Nippy Gelatin Industries): 100 wt. pts., glycerin: 30 wt. pts., coloring agent: 1 wt. pts., xylitol (soluble crystalline substance, xylitol made by Towa Chemical C.): 0 (comparison example), 20, 40, 80, 120, 160, 200, 240 wt. pts., water: 90 wt. pts. of solution are used. Air is removed from the aforementioned solution (70 deg.C), this is filtered, the rotation metal type soft capsule filling machine is used. The capsule (OVAL, No. 5) encapsulating the contents is molded and solidified. Then, the air in the atmosphere is a humidity of 30% and temperature of 31 deg. C and the rotation type air transfer dryer is used for 5 hours. Next, after it is left for 3

hours in the air having a humidity of 80% and temperature of 28 deg. C, then, the air in the atmosphere is a humidity of 30% and temperature of 31 deg. C and the rotation type air transfer dryer is used for 12 hours. Finally, the film moisture is about 10%. The product evaluation is performed for the 8 types of samples that are obtained (soft capsule state), the results are shown in Table 1 below.

[0025]

[Table 1]

Column 1: Xylitol addition amount

Column 2: Suitable process

Column 3: Whiteness on the surface due to the precipitate

Column 4: sweetness tasted instantaneously

Column 5: mutual adhesion

Column 6: total evaluation

| | - FD 707 1D. | 折出物に | 四時に成 | 相互付着 | 総合評価 |
|----------|--------------|---|------|------------|----------------|
| キシリト | 工程遊往 | | | 10.5.13/0 | 600 ED 27 1862 |
| …ル設加 | | よる姿面 | じる甘さ | | |
| 显 | | の食さ | | 1 | |
| | | *************************************** | | | |
| 0 | ₿ | × | × | _ <u> </u> | CONTROL |
| | | | | | |
| 20 | 0 | Δ | × | Δ | X |
| | • | | | | ļ |
| 40 | Ø | 0 | Δ | 0 | Δ |
| | | | I | | |
| 80 | Q) | 6 | 0 | 0 | 0 |
| | | | | } | |
| i 2 0 | 0 | • | 6 | 6 | 0 |
| | 1 | | | | I |
| 160 | 1 0 | © | 0 | 0 | |
| | | 1 | | | |
| 200 | Δ | 0 | 0 | 6 | Δ |
| | | | | | |
| 240 | × | . 😥 | Ø | Ø | × |

[0026] In Table 1, a suitable process is used for the evaluation according to the type of product. The whiteness on the surface is evaluated by the naked eye. The sweet taste is evaluated. The mutual adhesion is a temperature of 40 deg. C, humidity of 75% maintained for 14 days. From the result, the goodness is marked in this order 0, 0, triangle, x. The sample containing xylitol of good external appearance of weight ratio of 80 - 160 wt. pts., the fine white xylitol crystals are discharged out uniformly to the external surface. When swallowing, the cooling sensation from the xylitol can be sensed instantaneously. Also, mutual adhesion was not observed during storing. Furthermore, since the xylitol in the film can provide softness to the film, it can be swallowed easily. [0027] Furthermore, A of figure 1 is the diagram showing the cross section of the typical model of the sample produced. 1 is the soft capsule wrapper, 3 is the vitamin E containing oil (contents), 5 is the precipitate discharged xylitol.

[0028] Implementation example 2

The top surface of the commercial cholera tablet is sprayed coated uniformly and a film is formed and solidified using the hot solution used in Implementation example 1 in the processing atmosphere used in implementation example 1,

this is dried. The product evaluation test is performed for the 8 different samples (film state), the result of these, the suitable process, the whiteness on the surface, the sweetness, the mutual adhesion show good results. The film is separated into 2 layers.

[0029] Furthermore, B in figure 1 is the diagram showing the cross section of the typical model of the sample that is produced in Implementation example 2. 7 is the film wrapper, 9 is the cholera tablet (contents), 11 is the discharged xylitol precipitate.

[0030] Implementation example 3

The air is used as the contents. An example of the encasing solution is gelatin (alkali gelatin (Bloom 165-185) made by Nippy Gelatin Industries): 100 wt. pts., glycerin: 30 wt. pts., natural sweetener: 5 wt. pts., caramel color: 1 wt. pts., natural caffeine (crystallized water soluble substance, tea made by Kosei Pharmacy Co.): 0 (comparison example), 5, 10, 50, 100 wt. pts., water: 90 wt. pts. of solution are used. Then, the processing atmosphere used in Implementation example 1 is used, the soft capsule (ROUND, No. 3) is molded according to the process used in implementation example 1, solidified and dried. The product evaluation is performed for the 5 types of samples that are

obtained (soft capsule state), the results are shown in Table 2 below.

/5

[0031]

[Table 2]

Column 1: Caffeine addition amount

Column 2: suitable process

Column 3: The whiteness at the surface due to the

precipitate

Column 4: mutual adhesion

Column 5: total evaluation

| カフェイ ン銃加量 | 工程通性 | 折出物に よる変面 の白さ | 財時に感 じる甘さ | 相互付務 | 松 合評価 |
|--------------|----------|---------------------|--------------|------|--------------|
| 0 | 6 | × | × | Δ | CONTROL |
| 5 | 0 | Δ_ | © | Δ | 0 |
| 10 | 0 | 0 | ©_ | 0 | 0 |
| 50 | Δ | 0 | \$ | 0 | Δ |
| 100 | × | | , | | |

[0032] In Table 2, the suitable process, the whiteness on the surface, the bitterness, the mutual adhesion are evaluated with the method similar to Table 1. Furthermore, [..] means all the dissolved solution cannot be prepared, it shows stopping in the middle. The sample of good external appearance containing caffeine of weight ratio of 5-10 wt. pts., the fine white caffeine crystals are

discharged out uniformly to the external surface. When swallowing, the bitter taste of the caffeine can be tasted instantaneously. Also, mutual adhesion was not observed during storing. Furthermore, this sample is chewy like chewing gum so can be taken like "chewing gum".

[0033] Furthermore, C of figure 1 is the diagram showing the cross section of the typical model of the sample produced in Implementation example 3. 13 is the soft capsule wrapper, 15 is the air (contents), 17 is the precipitate discharged caffeine.

[0034] Implementation example 4

Solid chocolate is used as the contents. An example of the encasing solution is gelatin (alkali gelatin (Bloom 165-185) made by Nippy Gelatin Industries): 100 wt. pts., pectin (made by San Co., HM): 2 wt. pts., erythritol (crystallized water soluble substance made by Japan Research Chemicals): 0 (comparison example), 50, 100, 150, 200 wt. pts., water: 90 wt. pts. of solution are used. Then, the processing atmosphere used in Implementation example 1 is used, the chocolate is immersed, the lift off film is molded, solidified and dried.

[0035] The suitable process, the whiteness on the surface, the sweetness, the mutual adhesion are evaluated for the 5 samples (film state) that were obtained, the film is

divided into 2 layers. This film does not dissolve under high temperature in the summer, the chocolate is not released.

[0036] Furthermore, D of figure 1 is the diagram showing the cross section of the typical model of the sample produced in Implementation example 4. 19 is the film wrapper, 21 is the chocolate (contents), 23 is the precipitate discharging the erythritol.

[0037] Implementation example 5

Bath salts are used as the contents. An example of the encasing solution is gelatin (alkali gelatin (Bloom 165-185) made by Nippy gelatin Industries): 100 wt. pts., glycerin: 30 wt. pts., maltose (crystallized water soluble substance made by Japan Food Product Industries):50 wt. pts., water: 90 wt. pts. are used. The processing atmosphere used in Implementation example 1 is used, the soft capsule (ROUND, no. 160) is molded, solidified and dried according to the process used in Implementation example 1.

[0038] The result obtained from performing the product evaluation test for the sample that is obtained (soft capsule state), the mutual adhesion during storage and blocking are not observed as compared to the conventional

methods. The contents are released when broken up directly in the hot water for bath.

[0039] Furthermore, E of figure 1 is the diagram showing the cross section of the typical model of the sample produced in Implementation example 5. 25 is the soft capsule wrapper, 27 is the bath salt (contents), 29 is the precipitate discharging the maltose.

[0040] Implementation example 6

Aloe powder of strong bitter taste is used as the contents. An example of the encasing solution is gelatin (alkali gelatin (Bloom 165-185) made by Nippy Gelatin Industries):

100 wt. pts., emulsion agent : 1 wt. pts., fructose

(crystallized water soluble substance made by Kato Chemical

Co): 20 wt. pts., water: 150 wt. pts. are used. The

aforementioned solution (70 deg. C) is vacuum packed, the

viscosity is adjusted, then, stainless steel pin is

immersed into this solution, it is lift up while rotating

and molded, solidified. Directly after this, the moisture

on the film is dried to about 12% under the atmospheric air

at 25 deg. C and 30% humidity. The wrapper in the container

form is made. Then, aloe powder is introduced inside and

sealed.

[0041] The result obtained from performing the product evaluation test for the sample that is obtained (hard

capsule state), the mutual adhesion during storage and blocking are not observed as compared the conventional method, and it can be swallowed easily. Also, the layer of capsule is separated into two layers.

16

[0042] Furthermore, F of figure 1 is the diagram showing the cross section of the typical model of the sample produced in Implementation example 1. 31 is the hard capsule wrapper, 33 is the aloe powder (contents), 35 is the precipitate discharging the fructose.

[0043]

[Effect of invention] When the encased particle substance of the invention is swallowed or eaten, the taste due to the dissolving of the precipitate that discharged out into the external surface, the taste that accompanied this and the cooling sensation can be felt instantaneously. When it is in storage, the mutual adhesion and blocking in the precipitate of the particle substance can be prevented. Also, the precipitate is discharged out uniformly to the external surface and the external appearance of the product is good. In addition, when a part of the precipitate remained in the wrapper, it can be broken down easily and the discharge is soft.

[Brief description of the diagrams]

[Figure 1] This is the diagram showing the cross section of the encased particle substance pertaining to the implementation example of the invention.

[Description of the symbols]

- 1 31 Wrapper
- 3 33 contents
- 5 35 precipitate

[Figure 1]

